(19)日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出顧公開番号

特開平11-335261

(43)公開日 平成11年(1999)12月7日

(5i) Int.Cl.⁶ 酸別記号 F I
A 6 1 K 7/48 A 6 1 K 7/48
7/00 7/00 T
N
7/42 7/42

審査請求 未請求 請求項の数35 OL (全 19 頁)

(21)出願番号 特願平11-129989

(22)出願日 平成11年(1999)5月11日

(31)優先権主張番号 98810421.2

(32)優先日 1998年5月11日

(33) 優先権主張国 ヨーロッパ特許庁(EP)

(71)出顧人 396023948

チパ スペシャルティ ケミカルズ ホールディング インコーボレーテッド Ciba Specialty Chemicals Holding Inc. スイス国, 4057 パーゼル, クリベツクシュトラーセ 141

(71)出顕人 595157341

フェジファクト アクチェンゲゼルシャフ ト

スイス国,6340 パール,ジェーフラーベ

(74)代理人 弁理士 津国 肇 (外1名)

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 化粧品最終処方物におけるナノディスパージョンの使用

(57)【要約】

【課題】 簡単な工程で製造でき、広い叫範囲で安定な、ナノディスパージョンを含有する化粧品最終処方物及びその使用を提供する。

【解決手段】 (a) 膜形成分子、(b) 共乳化剤、および(c) 親油性成分を含むナノディスパージョンの、化粧品最終処方物の使用であって、該ナノディスパージョンが、(α) 成分(a)、(b) および(c) を混合して、均質で明澄な液体を得る工程、および(β) 工程(α) で得られた液体を化粧品最終処方物の水相に加える工程により、工程(α) および(β) をさらなるエネルギー供給なしで実施して得ることができることを特徴とする化粧品最終処方物とその使用; ならびにそのためのナノディスパージョン前駆相およびナノディスパージョン。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 (a) 膜形成分子、

- (b) 共乳化剤、および
- (c) 親油性成分を含むナノディスパージョンの、化粧品最終処方物への使用であって、該ナノディスパージョンが.
- (α)成分(a)、(b)および(c)を混合して、均 質で明澄な液体(いわゆるナノディスパージョン前駆 相)を得る工程、および
- (β) 工程 (α) で得られた液体を、化粧品最終処方物の水相に加える工程により、工程 (α) および (β) をさらなるエネルギー供給なしで実施して得ることができることを特徴とする使用。

【請求項2】 工程 (α) が無水媒体中で実施される、 請求項1記載の使用。

【請求項3】 工程(β)が均質化なしで実施される、 請求項1または2記載の使用。

【請求項4】 ナノディスパージョン中の粒子が、<5 Onmの平均直径を有する、請求項1~3のいずれか1項記載の使用。

【請求項5】 ナノディスパージョンが、

- (a) 膜形成分子としての、いわゆる二重層を形成する のに適した物質、
- (b) 共乳化剤としての、好ましくはO/W構造を形成 する物質、および
- (c) 親油性成分としての、化粧品に通例に使用される機能性親油性活性剤を含む、請求項1~4のいずれか1項記載の使用。

【請求項6】 ナノディスパージョンが、成分として、(a)リン脂質、水和もしくは部分水和リン脂質、リソリン脂質、セラミドまたはそれらの混合物を含む、請求項1~5のいずれか1項記載の使用。

【請求項7】 成分(a)が、成分(a)、(b)および(c)の総重量を基準として0.1~30重量%の濃度でナノディスパージョン中に存在する、請求項6記載の使用

【請求項8】 ナノディスパージョンが、成分として、(b) ポリオキシエチレンタイプの乳化剤、飽和および不飽和の $C_8 \sim C_{18}$ アルキル硫酸塩、 $C_8 \sim C_{20}$ 脂肪酸のアルカリ金属塩、アンモニウム塩、またはアミン塩、 $C_8 \sim C_{20}$ アルカンスルホン酸塩、脂肪アルコールリン酸塩、コール酸塩、逆性石酸(quats)、ソルビタン脂肪酸部分エステル、脂肪酸シュガーエステル、脂肪酸部分グリセリド、アルキルマルトシド、アルキルグルコシド、 $C_8 \sim C_{18}$ ベタイン、 $C_8 \sim C_{18}$ ズルホベタインもしくは $C_8 \sim C_{24}$ アルキルアミドー $C_1 \sim C_4$ アルキレンベタイン、タンパク質、ボリグリセリン脂肪酸エステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールまテル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロピレングリコールエステル、脂肪酸プロテートまたはこれらの物質の混合物を含む、請求項1~7のいずれか1項記載の使用。

【請求項9】 ナノディスパージョンが、成分として、 (b)少なくとも1種のポリオキシエチレンタイプの乳 化剤を含む、請求項8記載の使用。

【請求項10】 ナノディスパージョンが、成分とし て

(b) ポリオキシエチレンタイプの乳化剤またはこれらの物質の混合物を含む、請求項1~9のいずれか1項記載の使用。

【請求項11】 ナノディスパージョン中の成分(b) が、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンビタミン E誘導体、ポリオキシエチレン 脂肪酸部分グリセリド、ポリオキシエチレン脂肪での誘導体、ポリオキシエチレン脂肪である。ボリオキシエチレン脂肪アミンおよび脂肪酸アミド、ポリオキシエチレン脱肪アミンおよび脂肪酸アミド、ポリオキシエチレン炭水化物、またはエチレンオキシドとプロピレンオキシドとのブロックポリマーである、請求項10記載の使用。

【請求項12】 本発明によって使用されるナノディスパージョン中の成分(b)が、成分(a)、(b)および(c)の総重量を基準として1~50重量%の濃度で存在する、請求項1~11のいずれか1項記載の使用。 【請求項13】 ナノディスパージョンが、成分として、

(c) 天然または合成もしくは部分的に合成のジーもしくはトリグリセリド、鉱油、シリコーン油、ロウ、脂肪アルコール、ゲルベアルコールまたはそれらのエステル、日焼け止め剤をはじめとする親油性機能性化粧品活性剤またはこれらの物質の混合物を含む、請求項1~12のいずれか1項記載の使用。

【請求項14】 ナノディスパージョンが、成分として、

(c) 日焼け止め剤または脂溶性ビタミンを含む、請求項13記載の使用。

【請求項15】 成分(c)が化粧品最終処方物中に 0.1~80重量%の濃度で存在する、請求項1~14 のいずれか1項記載の使用。

【請求項16】 ナノディスパージョンが、成分として

(d) $C_2 \sim C_8$ アルコールを含む、請求項 $1 \sim 15$ のいずれか1 項記載の使用。

【請求項17】 ナノディスパージョンが最終処方物中 に0.01~99重量%の濃度で存在する、請求項1~ 16のいずれか1項記載の使用。

【請求項18】 成分(a)、(b)または(c)の少なくとも1種の成分が、皮膚、粘膜および毛髪を手入れまたは保護するために化粧品に使用される成分である、請求項1 \sim 17のいずれか1項記載の使用。

【請求項19】 請求項1記載のナノディスパージョン を含む、ゲルの形態である化粧品最終処方物。

【請求項20】 請求項1記載のナノディスパージョンを含む、クリーム、ローションまたはミルクの形態である化粧品最終処方物。

【請求項21】 請求項1記載のナノディスパージョンを含む、スティックの形態である化粧品最終処方物。

【請求項22】 請求項1記載のナノディスパージョンを含む、スプレーまたはエーロゾルの形態である化粧品 最終処方物。

【請求項23】 請求項1記載のナノディスパージョンを含む、泡の形態である化粧品最終処方物。

【請求項24】 請求項1記載のナノディスパージョンを含む、ペーストの形態である化粧品最終処方物。

【請求項25】 ナノディスパージョンが、水相中に存在する、請求項19~24のいずれか1項記載の化粧品最終処方物。

【請求項26】 水相が、0.01~20重量%の濃度のナノディスパージョンを含む、請求項25記載の化粧品最終処方物。

【請求項27】 請求項1記載のナノディスパージョンを含み、該ナノディスパージョンが脱水形態で存在する、粉末、ラッカ、ペレットまたはメーキャップの形態にある化粧品最終処方物。

【請求項28】 皮膚、粘膜もしくは毛髪を手入れまたは保護するための、請求項19~27のいずれか1項記載の化粧品最終処方物の使用。

【請求項29】 日焼け止め剤としての、請求項19~27のいずれか1項記載の化粧品最終処方物の使用。

【請求項30】 日焼け後用製剤としての、請求項19 ~26のいずれか1項記載の化粧品最終処方物の使用。

【請求項31】 (a) 膜形成分子、

(b) 共乳化剤、

- (c) 親油性成分および、場合によっては、
- (d) $C_2 \sim C_8$ アルコールを、均質で明澄な液体が得られるまで混合し、混合を無水媒体中で実施することによって得ることができるナノディスパージョン前駆相。

【請求項32】 混合がさらなるエネルギー供給なしで 実施される、請求項31記載のナノディスパージョン前 駆相。

【請求項33】 請求項31記載のナノディスパージョン前駆相を含む、油またはラッカの形態にある化粧品最終処方物。

【請求項34】 油溶性染料のキャリヤ系としての、請求項1記載のナノディスパージョンの使用。

【請求項35】 (a) 膜形成分子、

- (b) 共乳化剤、および
- (c)親油性成分を含むナノディスパージョンであって、
- (α) 成分 (a)、(b) および (c) を混合して、均

質で明澄な液体を得る工程、および

 (β) 工程 (α) で得られた液体を、水相に加える工程により、工程 (α) および (β) をさらなるエネルギー供給なして実施して得ることができることを特徴とするナノディスパージョン。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【発明の属する技術分野】本発明は、化粧品最終処方物における特定のナノディスパージョン(ナノ分散物)の使用、該ナノディスパージョンを含む化粧品最終処方物およびそのような最終処方物の種々の化粧品用途に関する。

[0002]

【従来の技術および発明が解決しようとする課題】化粧品調製物は、化粧品処方物を形成するための基本物質に加えて、他の機能性活性剤を含む。これらは、化粧品ベース処方に加えられ、たとえば、皮膚の手入れ、保護、着色、清浄化、殺菌および湿潤ならびに皮膚または毛髪の再生および活性化のために使用される。

【0003】これらの物質が所望の部位で効果を示すためには、これらの物質を、いわゆるキャリヤおよび送達ビヒクル(キャリヤ系)により、それぞれの部位、たとえば皮膚表面、粘膜、爪、歯エナメル質または毛髪だけでなく、皮膚の表皮領域および真皮領域にも送達しなければならない。このためには、多くの化粧品活性剤、たとえば水溶性ビタミン、アミノ酸群または水溶性メラニンが、リボソームに封入されている。リボソームの性質のために、親油性物質は、リボソーム膜の親油性領域に少量でしか封入することができない。この理由のため、いわゆるナノ乳濁液(ナノ粒子とも呼ばれる)が、そのような化合物、たとえば脂溶性ビタミンに使用される。【0004】膜および膜形成分子の物理的および化学的性質のために、従来の化粧品処方物におけるキャリヤ系の使用は、厳しく制限される。

【0005】従来の構造を有する膜は、多くの化粧品調製物の基礎を形成するか、いわゆる活性剤もしくは賦形剤として化粧品最終処方物中に存在する両親媒性物質、たとえばイオン性もしくは非イオン性の乳化剤、脂肪アミン、両性乳化剤、洗浄性界面活性剤、増粘剤または防腐剤にきわめて影響されやすい。膜の構造は、そのような物質の存在において変化し、それが、調製中に添加されるキャリヤ系の破壊を生じさせかねない。

【0006】通常の膜はまた、酸および塩基の攻撃にもさらされる。したがって、たとえば、リン脂質を含有するキャリヤ系を、pH約6.5のいわゆるpH最適値の範囲でしか使用することができないことになる。pHを上下させることは、結果的に、膜形成分子の加水分解を生じさせる。

[0007]

【課題を解決するための手段】驚くべきことに、今、非

常に簡単な方法で、適切な組成のナノディスパージョンを、両親媒性物質の存在下に、広いpH範囲で化粧品最終処方物に組み込み、同時に形態学的および物理化学的性質を保持することができることが見出された。

【0008】したがって、本発明は、化粧品最終処方物における(a)膜形成分子、(b)共乳化剤、および(c)親油性成分を含むナノディスパージョンの使用であって、該ナノディスパージョンが、(α)成分

(a)、(b)および(c)を混合して、均質で明澄な液体(いわゆるナノディスパージョン前駆相)を得る工程、および(β)工程(α)で得られた液体を、化粧品最終処方物の水相に加える工程により、工程(α)および(β)をさらなるエネルギー供給なしで実施して得ることができる使用に関する。

[0009]

【発明の実施の形態】工程(α)は、通常、室温で、必要ならば加熱しながら、標準圧力条件の下で実施される。混合は、標準的な撹拌装置、たとえばプロペラ、角度付パドルまたは磁気撹拌器を使用して実施され、特別な機械的撹拌補助装置を使用することはない。

【0010】成分(a)、(b)および(c)(=工程(α))は、無水媒体中で混合される。すなわち、水を加える必要はない。

【0011】工程 (β) は、工程 (α) で得られた液体、すなわちナノディスパージョン前駆相を、化粧品最終処方物の水相に加えることによって実施される。成分 (α)、(α) がおよび (α) の具体的な選択が、超微細な単分散性ナノディスパージョンを直接もたらす。この場合、粗分散性または少なくともヘテロ分散性の系を、微細な単分散系に転換するために通常実施される均質化を、ノズル式、回転子/固定子式または超音波式のホモジナイザによって、先に実施することも可能である。したがって、工程 (α) は、高いせん断力またはキャビテーション力の不在を特徴とする。

【0012】工程(β)は、通常、それぞれの油/水相反転温度(PIT)の範囲である室温で実施される。

【0013】処理工程(α)および(β)を特徴とするナノディスパージョンは、<50nm、通常は30nm未満の平均直径を有する粒子を含有する。分布は単分散であり、ガウス分布に合致する。

【0014】本発明によると、(a) 膜形成分子としての、いわゆる二重層を形成するのに適した物質、(b) 共乳化剤としての、好ましくはO/W構造を形成する物質、および(c) 親油性成分としての、化粧品に通例に使用される機能性親油性活性剤を含有するナノディスパージョンを使用することが好ましい。

【0015】ナノディスパージョンは、好ましくは、成分(a)として、リン脂質、水和もしくは部分水和リン脂質、リソリン脂質、セラミドまたはこれらの化合物の混合物を含有する。

【0016】非常に特に好ましいリン脂質は、式

(1):

[0017]

【化1】

$$CH_{2}-O-R_{1}$$
 $R_{2}-O-CH$
 $CH_{2}-O-P-O-R_{3}$
 OH
 OH

【0018】(式中、 R_1 は、 C_{10} ~ C_{20} アシルであり、 R_2 は、水素または C_{10} ~ C_{20} アシルであり、そして R_3 は、水素、2-トリメチルアミノー1-エチル、2-アミノー1-エチル、非置換であるか、1個またはいくつかのカルボキシ、ヒドロキシもしくはアミノ基によって置換されている C_1 ~ C_5 アルキル:イノシトールまたはグリセリル基である)のリン脂質またはそれらの化合物の塩である。

【0019】 $C_{10}\sim C_{20}$ アシルは、好ましくは、偶数個の炭素原子を含有する直鎖状 $C_{10}\sim C_{20}$ アルカノイルならびに二重結合および偶数個の炭素原子を含有する直鎖状 $C_{10}\sim C_{20}$ アルケノイルである。偶数個の炭素原子を含有する直鎖状 $C_{10}\sim C_{20}$ アルカノイルは、たとえば、n-ドデカノイル、n-テトラデカノイル、n-ヘキサデカノイルまたはn-オクタデカノイルである。

【0020】二重結合および偶数個の炭素原子を含有する直鎖状 $C_{10}\sim C_{20}$ アルケノイルは、たとえば、 $6-\nu$ スーもしくは6-トランスー、9-シスーもしくは9-トランスードデセノイル、-テトラデセノイル、-ヘキサデセノイル、-オクタデセノイルはたは-エイコセノイル、好ましくは9-シスーオクタデセノイル(オレオイル)および9, 12-シスーオクタデカシエノイルもしくは9, 12, 15-シスーオクタデカトリエノイルである。

【0021】 R_3 が2-トリメチルアミノ-1-エチルである式(1)のリン脂質を、慣用名でレシチンと呼び、 R_3 が2-アミノ-1-エチルである式(1)のリン脂質を、慣用名でセファリンと呼ぶ。適切なものは、たとえば、天然に由来するセファリンまたはレシチン、たとえば、異なる、または同一のアシル基を有する大豆または鶏卵のセファリンもしくはレシチン、またはそれらの混合物である。

【0022】式 (1) のリン脂質はまた、合成起源のものであってもよい。「合成リン脂質」は、 R_1 および R_2 に関して均一な組成を有するリン脂質を定義するために使用される。そのような合成リン脂質は、好ましくは、アシル基 R_1 および R_2 が一定の構造を有し、約95%を越える純度を有する一定の脂肪酸から誘導される、上記で定義したレシチンおよびセファリンである。 R_1 および R_2 は、同一であっても異なってもよいし、不飽和で

あっても飽和であってもよい。好ましくは、 R_1 は、飽和の、たとえばn-ヘキサデカノイルであり、 R_2 は、不飽和の、たとえば9-シスーオクタデセノイル(オレオイル)である。

【0023】「天然に由来する」リン脂質とは、 R_1 および R_2 に関して均一な組成を有しないリン脂質をいう。このような天然のリン脂質も同様に、アシル基 R_1 および R_2 が、天然に由来する脂肪酸混合物から誘導されるレシチンおよびセファリンである。

【0024】式(1)の要件「実質的に純粋な」リン脂質とは、式(1)のリン脂質の90重量%を越える、好ましくは95重量%を越える純度をいう。これは、適切な測定方法、たとえばろ紙クロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー、HPLCまたは酵素着色試験によって実証することができる。

【0025】式(1)のリン脂質では、 $C_1 \sim C_4$ アルキルとして定義される R_3 は、たとえばメチルまたはエチルである。メチルが好ましい。

【0026】 1個またはいくつかのカルボキシ、ヒドロキシもしくはアミノ基によって置換されている $C_1 \sim C_5$ アルキルとして定義される R_3 は、たとえば、2ーヒドロキシエチル、2, 3-ジヒドロキシーn-プロピル、カルボキシメチル、1-もしくは2-カルボキシエチル、ジカルボキシメチル、2-カルボキシー2-ヒドロキシエチルもしくは3-カルボキシー2, 3-ジヒドロキシーn-プロピル、3-アミノー3-カルボキシーn-プロピルまたは2-アミノー2-カルボキシーn-プロピルであり、好ましくは2-アミノー2-カルボキシエチルである。

【0027】これらの基を含有する式(1)のリン脂質は、塩の形態、たとえばナトリウム塩またはカリウム塩の形態で存在することができる。

【0028】 R_3 がイノシトールまたはグリセリル基である式(1)のリン脂質は、ホスファチジルイノシトールおよびホスファチジルグリセリンの名称で知られている。

【0029】式(1)のリン脂質におけるアシル基はまた、括弧内に記す慣用名ででも知られている。すなわち、9-シスードデセノイル(ラウロレオイル)、9-シスーテトラデセノイル(ミリストレオイル)、6-シスーオクタデセノイル(ペトロセロイル)、6-トランスーオクタデセノイル(ペトロセライドイル)、9-シスーオクタデセノイル(オレオイル)、9-トランスーオクタデセノイル(オレオイル)、9-トランスーオクタデセノイル(リノレオイル)、9,12-シスーオクタデカジエノイル(リノレオイル)、9,12,15ーシスーオクタデカトリエノイル(リノレノイル)、1ーシスーオクタデカドリエノイル(バセノイル)、1ーシスーオクタデセノイル(ガドレオイル)、5,8,11,14ーシスーエイコサテトラエノイル(アラキドノイ

ル)、nードデカノイル(ラウロイル)、nーテトラデカノイル(ミリストイル)、nーヘキサデカノイル(パルミトイル)、nーオクタデカノイル(ステアロイル)、nーエイコサノイル(アラキドイル)、nードコサノイル(ベヘノイル)、nーテトラコサノイル(リグノセロイル)である。

【0030】式(1)のリン脂質の塩は、好ましくは化粧品に許容可能である。塩は、置換基 R_3 中の塩形成基の存在およびリン原子における遊離ヒドロキシル基によって定義される。内部塩の形成もまた可能である。アルカリ金属塩、特にナトリウム塩が好ましい。

【0031】本発明の特に好ましい実施態様では、大豆からの、品質LIPOID S100またはS75の精製レシチン、またはモノグラフUSP23/NF18に定義されたレシチンが使用される。

【0032】成分(a)は、好ましくは、成分(a)、(b)および(c)の総重量を基準として約0.1~3 0重量%の濃度で使用される。

【0033】成分(b)は、好ましくは、好ましいO/W構造を形成する乳化剤または乳化剤混合物である。

【0034】特に好ましい乳化剤は以下のものである。 脂肪酸のアルカリ金属塩、アンモニウム塩およびアミン 塩。このような塩の例は、リチウム、ナトリウム、カリ ウム、アンモニウム、トリエチルアミン、エタノールア ミン、ジエタノールアミンまたはトリエタノールアミン 塩である。ナトリウム、カリウムまたはアンモニウム $(NR_1R_2R_3)$ 塩 $(R_1, R_2$ および R_3 は、それぞれ互 いに独立して、水素、C1~C4アルキルまたはC1~C4 ヒドロキシアルキルである)を使用することが好まし い。飽和および不飽和の脂肪族ヒドロカルビル硫酸、た とえばナトリウムドデシル硫酸、ならびにアルカンスル ホン酸塩、たとえばナトリウムドデカンスルホン酸塩; コール酸塩、たとえばコール酸ナトリウム、グリココー ル酸ナトリウムおよびタウロコール酸ナトリウム;逆性 石鹸 (quats)、たとえばセチルピリジニウムクロリ ド;ソルビタン部分脂肪酸エステル、たとえばソルビタ ンモノラウレート;脂肪酸シュガーエステル、たとえば スクロースモノラウレート : アルキルグルコシド、たと えばn-オクチルグルコシドまたはn-ドデシルグルコ シド;アルキルマルトシド、たとえばn-ドデシルマル トシド;脂肪酸部分グリセリド、たとえばラウリン酸モ ノグリセリド; C8~C18ベタイン、C8~C24アルキル アミドーC1~C4アルキレンベタインおよびC8~C18 スルホベタイン; タンパク質、たとえばカゼイン; 脂肪 酸ポリグリセリンエステル;脂肪酸プロピレングリコー ルエステル;脂肪酸ラクテート、たとえばナトリウムス テアロイルラクチル-2-ラクテート;脂肪アルコール リン酸塩。

【0035】ポリオキシエチレンタイプの乳化剤が、非常に特に好ましい。このような乳化剤の例は以下のもの

である。ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステ ル、たとえばポリソルベート80;ポリオキシエチレン 脂肪アルコール、たとえばOleth-20;ポリオキシエ チレン脂肪酸、たとえばポリオキシエチレン(20)ス テアレート;ポリオキシエチレンビタミンE誘導体、た とえばビタミンEポリエチレングリコール(1000) スクシネート ; ポリオキシエチレンラノリンおよびラノ リン誘導体、たとえばLaneth-20;ポリオキシエチレ ン脂肪酸部分グリセリド、たとえばジエチレングリコー ルモノステアレート:ポリオキシエチレンアルキルフェ ノールエーテル、たとえばポリオキシエチレン(11) エチルフェノールエーテル;ポリオキシエチレン脂肪ア ルコール硫酸半エステルおよびそれらの塩、たとえばC $_{12}\sim C_{14}$ 脂肪アルコールポリオキシエチレン(2)エー テル硫酸ナトリウム;ポリオキシエチレン脂肪アミンお よび脂肪酸アミド;ポリオキシエチレン炭水化物;エチ レンオキシドとプロピレンオキシドとのブロックポリマ 一、たとえばPoloxamer 188。

【0036】ナノディスパージョンは、好ましくは、成分(b)として、少なくとも1種のポリオキシエチレンタイプの乳化剤、非常に特に好ましくは、ポリオキシエチレンタイプの乳化剤またはそれらの物質の混合物を含有する。

【0037】成分(b)は、本発明によって使用されるナノディスパージョンの中に、成分(a)、(b)および(c)の総重量を基準として約 $1\sim50$ 重量%の濃度で存在する。

【0038】成分(c)は、好ましくは、天然または合成もしくは部分的に合成のジーもしくはトリグリセリド、鉱油、シリコーン油、ロウ、脂肪アルコール、ゲルベアルコールまたはそれらのエステル、日焼け止め剤をはじめとする親油性機能性化粧品活性剤またはそれらの物質の混合物である。

【0039】成分(c)は、特に好ましくは、日焼け止め剤または脂溶性ビタミンである。

【0040】皮膚化粧品に適した活性剤、活性剤組成物または活性剤抽出物は、皮膚または局所投与に認められた成分または成分の混合物である。

【0041】例を以下に挙げる。皮膚表面および毛髪に 対して清浄化作用を有する活性剤。皮膚を清浄化するた めに使用されるすべての物質、たとえば油、石鹸、合成 洗剤および固形物を包含する。

【0042】脱臭および制汗作用を有する活性剤。アルミニウムまたは亜鉛塩に基づく制汗剤、殺菌性または静菌性脱臭物質を含有する脱臭性物質、たとえばトリクロサン、ヘキサクロロフェン、アルコール類およびカチオン性物質、たとえば第四級アンモニウム塩ならびに吸臭剤、たとえばGrillocin(登録商標)(リシノール酸亜鉛と種々の添加物との混合物)または場合によって酸化防止剤、たとえば場合によってはブチルヒドロキシトルエンのような酸化防止剤と組み合わせたクエン酸トリエチル、またはイオン交換樹脂を包含する。

【0043】日光に対する保護を提供する活性剤(UVフィルタ)。適切な活性剤は、日光からのUV線を吸収し、それを熱に転換することができるフィルタ物質(日焼け止め剤)である。所望の効果に依存して、以下の日焼け止め剤が好ましい。たとえば、約280~315nmの範囲の、エネルギーに富み、日焼け効果のあるUV線を選択的に吸収し(UV-B吸収剤)、約315~400nmの長波範囲(UV-A範囲)を透過させる日焼け止め剤、ならびに315~400nmのUV-A範囲の長波放射線のみを吸収する日焼け止め剤(UV-A吸収剤)である

【0044】適切な日焼け止め剤は、たとえば、p-アミノ安息香酸誘導体、サリチル酸誘導体、ベンゾフェノン誘導体、ジベンゾイルメタン誘導体、ジフェニルアクリレート誘導体、ベンゾフラン誘導体のクラスからの有機UV吸収剤、1個以上の有機ケイ酸基を含有するポリマーUV吸収剤、ケイ皮酸誘導体、ショウノウ誘導体、トリアニリノーsートリアジン誘導体、フェニルベンズイミダゾールスルホン酸およびそれらの塩、メンチルアントラニレート、ベンゾトリアゾール誘導体および/または酸化アルミニウムもしくは二酸化ケイ素で封入されたTiO2、酸化亜鉛もしくは雲母からなる群より選択される無機マイクロ顔料である。

【0045】p-アミノ安息香酸誘導体化合物の例は、 4-アミノ安息香酸(PABA);式(2): 【0046】

【化2】

5性剤。皮膚を清浄化するた CH₃CH(OH)CH₂、

$$CH_3CH(OH)CH_2$$
 N— $COOC_2H_5$ (2)

[0047]のエチルジヒドロキシプロピル-PABA;式(3):

【0048】 【化3】

【化3 CH_CH_)。

【0049】(式中、m、nおよびxは、同じ意味を有し、それぞれ最大で25である)のPEG-25-PA

BA;式(4): 【0050】

【0051】のオクチルジメチルPABA; または式

[0052]

(5):

【化5】

(5)

【0053】のグリシルアミノ安息香酸エステルである。

【0054】サリチル酸誘導体化合物の例は、式

(6):

[0055]

【化6】

【0056】のサリチル酸ホモメンチル;式(7):

[0057]

【化7】

【0058】のサリチル酸トリエタノールアミン;式

(8):

[0059]

【化8】

【0060】のo-ヒドロキシ-p-ジメチルアミノ安息香酸アミル;式(9):

[0061]

【化9】

【0062】のサリチル酸オクチル;または式(1

0):

[0063]

【化10】

【0064】のサリチル酸-4-イソプロピルベンジル である。

【0065】ベンゾフェノン誘導体化合物の例は、ベン ゾフェノン-3-(2-ヒドロキシー4-メトキシベン ゾフェノン)、ベンゾフェノン-4-(2-ヒドロキシ -4-メトキシベンゾフェノン-5-スルホン酸)また はベンゾフェノン-8-(2,2'-ジヒドロキシ-4 -メトキシベンゾフェノン)である。

【0066】ジベンゾイルメタン誘導体化合物の例は、 ブチルメトキシジベンゾイルメタンー[1-(4-tert-ブチル)-3-(4-メトキシフェニル)プロパンー1.3-ジオン]である。

【0067】ジフェニルアクリレート誘導体化合物の例は、オクトクリレン(2-エチルヘキシル-2-シアノ-3,3'-ジフェニルアクリレート)またはエトクリレン(エチル-2-シアノ-3,3'-ジフェニルアクリレート)である。

【0068】ベンゾフラン誘導体化合物の例は、3-(ベンゾフラニル)-2-シアノアクリレート、2-(2-ベンゾフラニル)-5-tert-ブチルベンゾキサ ゾールまたは2-(p-アミノフェニル)ベンゾフラ ン、特に、式(11):

[0069]

【化11】

【0070】または式(12):

[0071]

【化12】

【0072】の化合物である。

【0073】1個以上の有機ケイ素基を含有するポリマ

-UV吸収剤化合物の例は、ベンジリデンマロネート誘

導体、特に、式(13): 【0074】

【化13】

【0075】(式中、R₂₄は、水素またはメトキシであり、rは約7である)の化合物;式(14):

【0076】 【化14】 O-Si(CH₂)。

OH O-Si(CH₃)₃

【0077】または式(15):

【化15】

[0078]

$$\begin{array}{c}
O-Si(CH_3)_3\\
O-Si-CH_3\\
O-Si(CH_3)_3
\end{array}$$

$$CH_3$$
(15)

【0079】の化合物である。

【0080】シンナメート化合物の例は、メトキシケイ 皮酸オクチル(4-メトキシケイ皮酸-2-エチルヘキ シルエステル)、メトキシケイ皮酸ジエタノールアミン (4-メトキシケイ皮酸のジエタノールアミン塩)、p -メトキシケイ皮酸イソアミル(4-エトキシケイ皮酸 -2-イソアミルエステル)、メチルケイ皮酸-2,5 -ジイソプロピルまたはケイ皮酸アミド誘導体である。 【0081】ショウノウ誘導体化合物の例は、4ーメチ ルベンジリデンショウノウ〔3-(4′-メチル)ベン ジリデンボルナン-2-オン]、3-ベンジリデンショ ウノウ (3-ベンジリデンボルナン-2-オン)、ポリ アクリルアミドメチルベンジリデンショウノウ(N-〔2(および4)-2-オキシボルン-3-イリデンメ チル) ベンジル) アクリルアミド重合体)、トリモニウ ムベンジリデンショウノウ硫酸塩〔3-(4´ートリメ チルアンモニウム) ベンジリデンボルナンー2ーオンメ (14)

【0082】トリアニリノーsートリアジン誘導体化合物の例は、米国特許第5,332,568号明細書、米国特計第5,252,323号明細書、国際特許第93/17002号公報および国際特許第97/03642号公報ならびにヨーロッパ公開特許第0,517,104号公報に記載のオクチルトリアジンー〔2,4,6-トリアニリノー(pーカルボー2′ーエチルー1′ーオキシ)ー1,3,5-トリアジンおよびトリアニリノーsートリアジン誘導体、ヨーロッパ公開特許第0,775,698号公報に記載のレゾルシニルトリアジン、特

に、式(16): 【0083】 【化16】

【化17】

【0084】または式(17):

[0085]

【0086】の化合物である。

【0087】ベンゾトリアゾール化合物の例は、2-(2-ヒドロキシ-5-メチルフェニル)ベンゾトリアゾール、およびヨーロッパ公開特許第0,746,305号公報に記載のベンゾトリアゾール化合物、特に、式(18):

[0088]

【化18】

HO
$$T_2$$
 CH_2 T_2 CH_3 T_4 CH_5 T_5

【0089】(式中、 T_2 は、水素または $C_1 \sim C_8$ アルキルである)の化合物である。

【0090】虫駆除剤。虫駆除剤は、虫が皮膚に触れ、そこで活動することを防ぐ組成物である。虫駆除剤は、虫を駆除し、ゆっくりと蒸発する。最も頻繁に使用される駆除剤は、ジエチルトルアミド(DEET)である。他の通例の駆除剤は、「W. Raab および U. Kindl「Pflegekosmetik」Gustav-Fischer-Verlag Stuttgart/NewYo

rk, 1991, p.161に記載されている。

【0091】化学的および機械的攻撃に対して保護する活性剤。皮膚と外部の有害物質との間に遮断層を形成するすべての物質、たとえば水溶液に対する保護として、パラフィン油、シリコーン油、植物油、PC L製品およびラノリン、有機溶媒の作用に対する膜形成剤、たとえばアルギン酸ナトリウム、アルギン酸トリエタノールアミン、ポリアクリレート、ポリビニルアルコールまたはセルロースエーテル、または皮膚への高い機械的応力に対する「潤滑剤」としての、鉱油、植物油もしくはシリコーン油に基づく物質を包含する。

【0092】湿潤物質、以下の物質が湿潤剤として使用される。たとえば、乳酸ナトリウム、尿素、アルコール類、ソルビトール、グリセリン、プロピレングリコール、コラーゲン、エラスチンまたはヒアルロン酸である。

【0093】セラトプラスチック活性を有する活性剤。 たとえば、過酸化ベンゾイル、レチン酸、コロイド状硫 黄およびレゾルシノールである。

【0094】抗微生物剤、たとえばトリクロサンまたは 第四アンモニウム化合物である。

【0095】経皮使用が可能な油脂状または脂溶性のビタミンまたはビタミン誘導体、たとえばビタミンA(遊離酸またはその誘導体の形態のゲチノール)、パンテノ

ール、パントテン酸、葉酸およびそれらの組み合わせ、 ビタミンE(トコフェロール)、ビタミンF、必須脂肪 酸またはニアシンアミド(ニコチン酸アミド)である。 【0096】ビタミンベースの胎盤抽出物。たとえば、 主としてビタミンA、C、E、B₂₁B₁₂、葉酸およびビ

主としてビタミンA、C、E、 B_{21} B_{12} 、棄骸およびビオチンと、アミノ酸および酵素との活性剤組成物、ならびにマグネシウム、ケイ素、リン、カルシウム、マンガン、鉄または銅ような微量元素の化合物である。

【0097】ビフィズス族の菌の不活性化され、破壊された培養物から得ることができる皮膚修復性複合体。

【0098】植物および植物抽出物。たとえばアルニカ、アロエ、サルオガセ、ツタ、イラクサ、ニンジン、ヘンナ、カモミレ、キンセンカ、ローズマリー、セージ、スギナまたはタイムである。

【0099】動物抽出物。たとえば、ローヤルゼリー、 プロポリスまたは胸腺抽出物である。

【0100】経皮使用が可能な化粧油。miglyol812 タイプの中性油、杏仁油、アボカド油、ババスー油、綿 実油、ルリチシャ油、アザミ油、アメリカホドイモ油、 ィーオリザノール、バラ実油、大麻油、ヘーゼルナッツ 油、スグリ実油、ホホバ油、サクランボ油、サーモン 油、亜麻仁油、トウモロコシ油、マカダミアナッツ油、 アーモンド油、マツヨイグサ油、ミンク油、オリーブ 油、ピーカンナッツ油、桃仁油、ピスタチオナッツ油、 菜種油、米胚芽油、ヒマシ油、サフラワー油、ゴマ油、 大豆油、ヒマワリ油、チャノキ油、グレープシード油ま たは小麦胚芽油である。

【0101】成分(c)は、本発明のナノディスパージョン中に、成分(a)、(b)および(c)の総重量を基準として、好ましくは0.1~80重量%の濃度で存在する。

【0102】成分(a)、(b)および(c)は、本発明によって使用されるナノディスパージョン中に、個々の化合物またはいくつかの異なる個々の成分の混合物として存在することができる。

【0103】ナノディスパージョン組成物中の成分 (a)、(b)または(c)の少なくとも1種は、通 常、皮膚、粘膜および毛髪を手入れまたは保護するため に化粧品に使用される機能性活性剤である。

【0104】本発明によって使用されるナノディスパージョンは、場合によっては、成分(d)として、可溶化剤、好ましくは $C_2 \sim C_8$ アルコール、たとえばエタノールまたはプロピレングリコールを含む。

【0105】成分(a)、(b)、(c)および場合によっては(d)を含有するナノディスパージョンは、可溶化した機能性化粧剤の好ましい相特性によって格別である。したがって、入射光中でオパール光と透明性があるならば、ごくわずかな濁りしかないことが、ディスパージョンが真正な分子溶液の理想状態からまだ物理的に異なることを示す。電子顕微鏡画像は、98%を越える

集団が、約50nm未満、通常は約30nm未満の粒子径を有する粒子(ナノ粒子)の懸濁液としてガウス分布状態にあることを示す。しかし、真正な溶液からのこれらの区別は、たとえば驚くほど高い貯蔵安定性、たとえば室温までの温度で数ヵ月間貯蔵した後でも分離しないことによって明らかにすることができる、ディスパージョンの特に良好な均質性のため、容認することができる(安定性の外挿法による予想値:2年を超える)。

【0106】レーザ光散乱測定および電子顕微鏡分析 (Cryo-TEM)が、ナノディスパージョン中に存在するナノ粒子の、非常に小さな粒径、および優れた均質性を確認する。

【0107】本発明によって使用されるナノディスパージョンのもう一つの利点は、それらが調製しやすいことである。

【0108】請求項1によって特徴づけられるナノディスパージョンは、本発明によって化粧品最終処方物に使用される。

【0109】本発明はまた、(a) 膜形成分子、(b) 共乳化剤、(c) 親油性成分、および場合によっては、(d) $C_2 \sim C_8$ アルコール、好ましくはプロピレングリコール、より好ましくはエタノールを、均質で明澄な液体が得られるまで混合し、混合を無水媒体中で実施することによって得ることができる、工程(α) で特徴づけられるいわゆるナノディスパージョン前駆相に関する。【01-1-0】これらのナノディスパージョン前駆相も同様に、本発明によって化粧品最終処方物に直接使用することができる。

【0111】化粧品最終処方物は、非常に広い範囲の化粧品を包含する。適切な製品は、たとえば、特に以下のものである。

【0112】スキンケア製品、たとえば、固形石鹸もしくは液体石鹸、合成洗剤または洗浄ペーストの形態にある皮膚洗浄および清浄化製品;

【0113】浴室製品、たとえば液体(泡風呂、ミルク、シャワー製品)または固体の浴室製品、たとえばバスパールおよびバスソルト:

【0114】スキンケア製品、たとえば皮膚用エマルション、マルチプルエマルションまたはスキンオイル;

【0115】装飾性ボディーケア製品、たとえばデイクリームまたはパウダークリーム、おしろい(ルーズおよび圧縮)、ルージュまたはクリームメーキャップの形態にあるフェイスメーキャップ;アイケア製品、たとえばアイシャドウ製品、マスカラ、アイライナ、アイクリームまたは目固定クリーム;リップケア製品、たとえばリップスティック、リップグロス、リップライナ;ネイルケア製品、たとえばマニキュア、マニキュア除去剤、爪硬化剤または角皮除去剤;

【0116】女性用衛生製品、たとえば女性用衛生洗浄ローションまたはスプレー:

【0117】フットケア製品、たとえばフットバス、フットパウダー、フットクリームまたはフットバルム、特殊な脱臭剤および制汗または皮膚肥厚をこすり落とすための製品;

【0118】日焼け止め剤、たとえばサンミルク、ローション、クリーム、オイル、サンブロッカまたはトロピカル、日焼け前用製品または日焼け後用製品;

【0119】日焼け用製品、たとえばセルフタニングク リーム;

【0120】脱色素用製品、たとえば皮膚を白く、または明るくするための製品;

【0121】虫駆除剤、たとえば虫除けオイル、ローション、スプレーまたはスティック;

【0122】脱臭剤、たとえば脱臭スプレー、非エーロ ゾルスプレー、脱臭ゲル、スティックまたはロールオ ン:

【 0 1 2 3 】制汗剤、たとえば制汗スティック、クリー ムまたはロールオン ;

【0124】不純物を含む皮膚を清浄化または手入れするための製品、たとえば合成洗剤(固体または液体)、 剥離またはスクラブ製品または剥離マスク;

【0125】化学脱毛製品、たとえば脱毛パウダー、液体脱毛製品、クリーム状またはペースト状脱毛製品、脱毛ゲルまたはエーロゾルフォーム;

【0126】髭剃り製品、たとえば髭剃り石鹸、泡立ちシェービングクリーム、泡なしシェービングクリーム、 シェービングフォームおよびゲル、ドライシェービング のためのプレシェーブ製品、アフターシェーブまたはアフターシェーブローション;

【0127】におい、たとえば香水(オーデコロン、オードトワレ、オードパルファン、パルファムデトワレ、香水)、芳香油または芳香クリーム;

【0128】口腔および歯の衛生ならびに義歯のための 製品、たとえば歯磨きペースト、歯磨きゲル、歯磨き粉 末、マウスウォッシュ濃縮物、歯垢除去用マウスウォッ シュ、義歯洗浄製品または義歯付着用製品;

【0129】毛髪の手入れのための化粧品処方物、たとえばシャンプー、ヘアコンディショナーの形態の毛髪洗浄剤、ヘアケア製品、たとえば前処理製品、ヘアトニック、ヘアスタイリングクリームおよびゲル、ボマード、ヘアリンス、ディープコンディショニングトリートメント、集中的ヘアケアトリートメント;ヘアセット製品、たとえばパーマ用ウェーブ剤(ホットウェーブ、マイルドウェーブ、コールドウェーブ)、ストレートパーマ製品、液体毛髪固定剤、ヘアフォーム、ヘアスプレー;漂白剤、たとえば過酸化水素溶液、漂白シャンプー、漂白クリーム、漂白粉末、漂白ペーストまたは油;一時的、半一時的または永久的毛髪染料;自己酸化染料を含有する製品または天然毛髪染料、たとえばヘンナもしくはカモミール。

【0130】上記に挙げた最終処方物は、非常に広い範囲の提示形態、たとえば、〇/Wエマルションとしての液状処方の形態;ゲルの形態;オイル、クリーム、ミルクまたはローションの形態;粉末、ラッカ、ペレットまたはメーキャップの形態;スティックの形態;スプレー(噴射剤を含むスプレーまたは非エーロゾルスプレー)またはエーロゾルの形態;泡の形態;またはペーストの形態であることができる。

【0131】この場合、液体および半固体の提示形態は、成分(a)、(b)および(c)を水相に有するナノディスパージョンと、1種またはいくつかの上記機能性化粧品活性剤とを含有する。固形の提示形態は、ナノディスパージョンを脱水形態で含有する。ナノディスパージョンの脱水は普通、通例の助剤の存在下での凍結乾燥または噴霧乾燥によって実施される。最終処方物によっては、ナノディスパージョンに代えて対応するナノディスパージョン前駆相を用いることが有利である。

【 O 1 3 2 】 エマルションとは、互いに混和しない、または部分的にしか混和しない2種の液体(相)からなる不均質系である。一方の相は滴の形態(分散相または内部相)で存在し、他方の相は液体として連続相を形成する。O/W乳濁液の場合、基本的には水を特徴とし、油滴が水中に微分散している。

【0133】クリームは通常、室温から皮膚の温度の範囲で延展することができるが、ローションまたはミルクは、注ぐことができるほどである。

【0134】ゲルは、いわゆるゲル形成体が、液体が固定化される三次元ネットワークを形成している半固形でいくらか透明な系である。明澄ないし不透明なヒドロゲルは、主に、水、水溶性物質および増粘剤もしくはゲル形成体からなる。脂質がさらに組み込まれるならば、わずかにクリーム状の見かけを有するヒドロ分散ゲルが得られる。対照的に、オレオゲルは水を含まず、液状成分として脂質を含有する。

【0135】上述の提示された形態であることができる、上記成分の1種またはいくつかを含有する化粧品最終処方物は、本発明によって使用されるナノディスパージョンを、0.01~100重量%、好ましくは0.01~20.0%重量、より好ましくは0.05~5重量%の濃度で含有する。

【0136】これらの最終処方物が、本発明のもう一つの主題である。

【0137】この場合、最終処方物は、水相にあるナノディスパージョンを、0.01~20.0重量%、好ましくは0.05~10%重量、より好ましくは0.1~5重量%の濃度で含有する。

【0138】本発明によって使用される最終処方物はまた、他の成分、たとえば皮膚エモリエント、エマルション安定剤、皮膚湿潤剤、日焼け促進剤、増粘剤、たとえばキサンタン、水分保持剤、たとえばグリセリン、防腐

削、たとえばパラヒドロキシ安息香酸アルキルエステル、酸化防止剤ならびに着香剤および着色剤を含有する ことができる。

【0139】例14~21の化粧品最終処方物の基本処方物は、「Kosmetik; Entwicklung, Herstellung und An wendung kosmetischer Mittel」(W. Umback編, Georg Thieme Verlag Stuttgart, New York)における指示および「DGK Fortbildungskurs1998, Entwicklung modern er Hautpflegemittel」からの文書によって調製される。

【0140】最終処方物は、いくつかは上記文献に記載されている通例の公知の方法によって調製される。液状および半固体の最終処方物の場合、ナノディスパージョンは、常に最終処方物の水相に組み込まれる。このために、それらは水相の小さな割合に取られ、活性剤相として、処方の調製中の最後の相として約20~30℃で添加される。ナノディスパージョン前駆相を、最終処方物の水相に加えることも可能である。ナノディスパージョン前駆相を、撹拌しながら、好ましくはそれぞれの油/水相反転温度(PIT)の範囲の温度で水相に添加する。

【 O 1 4 1 】 固形の最終処方物の場合、脱水形態のナノディスパージョンを固形物質混合物に添加混合することが有利である。

【0142】化粧品最終処方物は、好ましくは、皮膚、 粘膜または毛髪の手入れおよび保護に使用され、非常に 特に、日焼け止め剤または日焼け後用の製剤として使用 される。

【0143】本発明によって使用されるナノディスパージョンはまた、油溶染料の送達ビヒクルとして使用することができる。

【0144】もう一つの態様で、本発明は、請求項1に 定義されるナノディスパージョンの、油溶染料のキャリ ヤ系としての使用に関する。

【0145】適切な染料は、合成または天然に由来するものであり、すべての公知の発色団、たとえばアゾ、アゾイック、アントラキノン、カラテノイド、キノリン、キサンテン、ジアリールメタン、トリアリールメタン、スチルベン、インディゴイド、フタロシアニン、ニトロ染料ならびにカラーインデックスにCI11000~CI77999として掲載されているすべての他の公知の発色団から構成される。

【0146】これらの染料のうち、有機媒体、たとえば油に少なくとも部分的に可溶性であるものが特に興味深い。これは、たとえば、ソルベント染料または分散染料と呼ばれる染料を包含し、分散染料はまた、無添加の直接吸収性の毛髪染料、たとえばニトロベンゼンまたはニトロジフェニルアミンの誘導体を包含する。

【0147】本発明によって使用できるソルベント染料の例は、ソルベントブラック3(Cas-NO.4197-2

5-5)、ソルベントブラック5 (Cas-NO. 1 1 0 9 9 -0 3 - 9)、ソルベントブルー 3 5 (Cas-NO. 1 2 7 6 9 - 1 7 - 4)、ソルベントグリーン3、ソルベントグリーン7 (Cas-NO. 6 3 5 8 - 6 9 - 6)、ソルベントオレンジ1 (Cas-NO. 2 0 5 1 - 8 5 - 6)、ソルベントナッド 2 4 (Cas-NO. 8 5 - 8 3 - 6)、ソルベントレッド 4 3 (Cas-NO. 1 5 0 8 6 - 9 4 - 9)、ソルベントレッド 4 8 (Cas-NO. 1 3 4 7 3 - 2 6 - 2)、ソルベントレッド 4 9: 1 (Cas-NO. 6 3 7 3 - 0 7 - 5)、ソルベントレッド 7 2 (Cas-NO. 5 9 6 - 0 3 - 2)、ソルベントイエロー 4 4 (Cas-NO. 2 4 7 8 - 2 0 - 8)、ソルベントイエロー 1 8 (Cas-NO. 6 4 0 7 - 7 6 - 9) である。

【0148】本発明によって使用できる分散染料の例は、ディスパースブラック9(Cas-NO.12222-60-4)、ディスパースブルー1(Cas-NO.2475-45-8)、ディスパースブルー3(Cas-NO.2475-46-9)、ディスパースブラウン1(Cas-NO.23355-64-8)、ディスパースオレンジ3(Cas-NO.730-40-5)、式

[0149]

【化19】

【0150】の化合物、ディスパースバイオレット1 (Cas-NO.128-95-0)、ディスパースバイオレット4(Cas-NO.1220-94-6)、式 【0151】

【化20】

【0152】の化合物であり、(無添加の)直接吸収毛 髪染料の例は、HCブルーNo.2 (Cas-NO.33229-34-4)、HCブルーNo.4 (N-メチル-1,4-ジアミノアントラキノン、エピクロロヒドロンおよびモ ノエタノールアミンの反応生成物)、HCブルーNo.5 (Cas-NO.68478-64-8)、式

[0153]

【化21】

【0154】の化合物、HCブルーNo.7 (Cas-NO.90817-34-8)、HCブルーNo.8 (Cas-NO.22366-99-0)、HCブルーNo.9 (Cas-NO.114087-42-2)、HCブルーNo.10 (Cas-NO.102767-27-1)、HCブルーNo.11 (Cas-NO.23920-15-2)、HCブルーNo.12 (Cas-NO.132885-85-9)、式【0155】

【0156】の化合物、HCブルーNo.14 (Cas-NO.99788-75-7)、HCオレンジNo.1 (Cas-NO.54381-08-7)、HCオレンジNo.2 (Cas-NO.85765-48-6)、HCオレンジNo.3 (Cas-NO.81612-54-6)、式【0157】 【化23】

【0158】の化合物、HCレッドNo.1 (Cas-NO.2784-89-6)、HCレッドNo.3 (Cas-NO.2871-01-4)、HCレッドNo.7 (Cas-NO.24905-87-1)、HCレッドNo.8 (Cas-NO.13556-29-1)、HCレッドNo.9 (Cas-NO.56330-88-2)、HCレッドNo.10 (Cas-NO.95576-89-9)、HCレッドNo.11 (Cas-NO.95576-92-4)、HCレッドNo.13 (Cas-NO.94158-13-1)、式
【0159】
【化24】

【0160】の化合物、HCバイオレットNo.1 (Cas-N 0.82576-75-8)、式

【0162】の化合物、HCイエローNo.2 (Cas-NO.4 926-55-0)、HCイエローNo.4 (Cas-NO.59 820-43-8)、HCイエローNo.5 (Cas-NO.56 932-44-6)、HCイエローNo.6 (Cas-NO.10 4335-00-6)、式【0163】 【化26】

【0164】の化合物、HCイエローNo.8 (Cas-NO.6612-11-1)、HCイエローNo.9 (Cas-NO.86419-69-4)、HCイエローNo.10 (Cas-NO.109023-83-8)、HCイエローNo.11 (Cas-NO.73388-54-2)、HCイエローNo.12 (Cas-NO.59320-13-7)、HCイエローNo.13 (Cas-NO.10442-83-8)、式

【0165】 【化27】

【0166】の化合物、式 【0167】 【化28】

【0168】のHC化合物、式 【0169】 【化29】

【0170】の化合物、HCブラウンNo.1 (Cas-NO.83803-98-9)、HCブラウンNo.2 (Cas-NO.83803-99-0)、HCグリーンNo.1 (Cas-NO.52136-25-1)である。

[0171]

【発明の効果】本発明によって使用されるナノディスパ ージョンは、以下の機能を有することができる。すなわ ち、染料を特定の潜在的な壁に通過させて、媒体、たと えば皮膚、毛髪または爪に浸透させるためのキャリヤで あり、たとえば処方と固体との間の非相溶性を除くため に、染料を処方の他の成分から保護(または逆に、処方 を他の染料から保護) する。すると、染料は、処方の残 りからナノディスパージョンのコアに分離する。したが って、染料によって光開始される、他の成分との連鎖反 応を防止することが可能である。油相にしか溶けない染 料を水系に導入し、それを安定化させる。すると、染料 がナノディスパージョン(油相)のコアに溶解し、ナノ ディスパージョン粒子が逆に水相中に分散する。

[0172]

【実施例】以下の例では、%値は重量基準である。別段 記載しない限り、使用する化合物の量は、純物質に基づ く。

【0173】ナノディスパージョン前駆相の例

例1:Miglyol 812ナノディスパージョン前駆相

大豆レシチン

17.30%

ポリソルベート80

34.00%

Miglyol 812

34.50%

エタノール

14.20%

調製: Miglyol 812とポリソルベート80を混合し た。大豆レシチンをエタノールに溶解し、この混合物に 加えると、均質で明澄な液体が得られた。

【0174】例2: Miglyol 812ナノディスパージョ

大豆レシチン	17.	30%
01eth - 20	34.	00%
Miglyol 812	34.	50%
エタノール	14.	20%

調製: Miglyol 812とOleth-20を加熱しながら混 合した。大豆レシチンをエタノールに溶解し、この混合 物に加えると、均質で明澄な液体が得られた。

【0175】例3: Miglyol 812ナノディスパージョ ン前駆相

大豆レシチン	17.30%
Laneth-20	34.00%
Miglyol 812	34.50%
エタノール	14.20%

調製: Miglyol 812とLaneth-20を加熱しながら混 合した。大豆レシチンをエタノールに溶解し、この混合 物に加えると、均質で明澄な液体が得られた。

[0176]

例4:Miglyol 812ナノディスパージョン前駆相

17.30% 大豆レシチン ビタミンEポリエチレングリコールスクシネート 34.00% (ビタミンE TPGS、Eastman)

Miglyol 812 エタノール

34.50% 14.20%

ビタミンEアセテート 調製: Miglyol 812とビタミンEポリエチレングリコ Miglyol 812 ールスクシネートを加熱しながら混合した。大豆レシチ エタノール

ンをエタノールに溶解し、この混合物に加えると、均質 で明澄な液体が得られた。

【0177】例5:ビタミンEアセテートナノディスパ

ージョン前駆相

大豆レシチン

9.00% 34.00%

ポリソルベート80

13.00%

36.60%

7:40%

11.00%

調製: Miglyol 812、ビタミンEアセテートおよびポ リソルベート80を混合した。大豆レシチンをエタノー ルに溶解し、この混合物に加えると、均質で明澄な液体

が得られた。 [0178]

例6:Parsol MCX/Parsol 5000ナノディスパージョン前駆相

5.00% 大豆レシチン 34.00% ポリソルベート80 25.90% Parsol MCX (メトキシケイ皮酸オクチル) 11.10% Parsol 5000 (4-メチルベンジリデンショウノウ) 13.00% Miglyol 812

調製: Parsol 5000をParsol MCXに溶解し、Miglyol 812およびポリソルベート80と混合した。大豆レシ チンをエタノールに溶解し、この混合物に加えると、均

エタノール

質で明澄な液体が得られた。

[0179]

ナノディスパージョンの例

例7:Miglyol 812ナノディスパージョン

大豆レシチン

1.73%

```
3.40%
          ポリソルベート80
                                  3.45%
          Miglyol 812
                                  1.42%
          エタノール
                             合計100.00%になる量
          精製水
                               しながら (たとえば磁気撹拌器を使用して) 水相に加え
調製:水相 (たとえば90kg) を撹拌しながら (たとえ
ば磁気撹拌器で)50℃の容器に配置した。例1の液状
                               [0180]
ナノディスパージョン前駆相 (たとえば10kg) を撹拌
          例8: Miglyol 812ナノディスパージョン
                                  1.73%
          大豆レシチン
                                  3.40%
          01eth-20
                                  3.45%
          Miglyol 812
                                  1.42%
          エタノール
                              合計100.00%になる量
          精製水
                                [0181]
例7の手順と同様にして、調製を実施した。
          例9: Miglyol 812ナノディスパージョン
                               1.73%
          大豆レシチン
                               3.40%
          Laneth -20
                               3.45%
          Miglyol 812
                               1.42%
          エタノール
                          合計100.00%になる量
          精製水
例7の手順と同様にして、ナノディスパージョンを調製
                                [0182]
した。
          例10: Miglyol 812ナノディスパージョン
                                       1.73%
          大豆レシチン
          ビタミンEポリエチレングリコールスクシネート
                                       3.40%
           (ビタミンE TPGS、Eastman)
                                       3.45%
          Miglyol 812
                                       1.42%
          エタノール
                                  合計100.00%になる量
          精製水
                                [0183]
例7の手順と同様にして、ナノディスパージョンを調製
した。
          例11:デクスパントテノールナノディスパージョン
                                5.00%
          デクスパントテノール
                                1.73%
          大豆レシチン
                                3.40%
          ポリソルベート80
                                3.45%
          Miglyol 812
                                1.42%
          エタノール
                            合計100.00%になる量
           精製水
                                前駆相 (たとえば10kg) を、撹拌しながら (たとえば
調製:デクスパントテノールを含有する水相(たとえば
                                磁気撹拌器によって)水相に加えた。
9 Okg) を、撹拌しながら(たとえば磁気撹拌器で)5
0℃で容器に入れた。例1の液状ナノディスパージョン
                                 [0184]
           例12: ビタミンEアセテートナノディスパージョン
                                 2.00%
           ビタミンEアセテート
                                 0.49%
           大豆レシチン
                                 1.86%
           ポリソルベート80
                                 0.71%
           Miglyol 812
                                 0.63%
           エタノール
                            合計100.00%になる量
           精製水
                                の液状ナノディスパージョン前駆相(たとえば5.46
調製:水相(たとえば94.54kg)を、撹拌しながら
                                kg) を、撹拌しながら(たとえば磁気撹拌器によって)
```

(たとえば磁気撹拌器で)50℃で容器に入れた。例5

水相に加えた。

[0185]

例13: Parsol MCX/Parsol 5000ナノディスパージョン

Parsol MCX (メトキシケイ皮酸オクチル)

2. 59%
 1. 11%

Parsol 5000 (4-メチルベンジリデンショウノウ)

1. 11/0

Miglyol 812

1.30%

大豆レシチン

0.50%

ポリソルベート80

3.40%

エタノール

1.10%

精製水

合計100.00%になる量

例7の手順と同様にして、ナノディスパージョンを調製

まとめる。

した。

[0187]

【0186】粒子径および粒子径分布を、以下の表1に

【表1】

表 1:					
ナノディスパージョン	粒子径 ¹ (nm)	標準偏差 [nm]	粒径分布		
Migyloi 812 ナノディスパージョン 例 7	13.8	4.1	ガウス分布		
デクスパントテノール・ナノディスパージョン 例 11	19.7	5.4	ガウス分布		
ビタミン E アセテート ナノディスパージョン 例 12	12.2	5.5	ガウス分布		
Parsol MCX / parsol 5000 ナノディスパージョン 例 13	14.6	5.2	ガウス分布		

(注) 1: 粒子侵および粒子径分布は、レーザー光散乱(Nicomp 370 サブミクロン粒子径計による、粒子数を計量)によって測定した。

【0188】以下の表2、3が示すように、ナノディス

[0189]

パージョンはまた、優れた貯蔵安定性を有している。

【表2】

デクスパントテノール (例 11)

表 2					
貯蔵条件		pН	直径 ² [nm]	標準偏差 [nm]	デクスパントテノール 3 含有率 [%]
期間 [月]	温度 [°C]			-	
0		6.1	19.7	5.4	5.37
	7	6.1	19.0	6.7	5.36
3	25	6.1	22.2	7.7	5.32
	40	6.3	36.6	14.2	5.23
	7	6.1	20.8	7.3	5.30
6	25	6.2	24.1	9.2	5.28
	40	6.4	35.4	17.7	5.20

⁽注) 2: 粒子径および粒子径分布は、レーザー光散乱 (Nicomp 370 サブミクロン粒子径計によ

【表3】

る、体積を計量)によって測定した。 3: デクスパントテノール含有率は、HPLCによって測定した。

ビタミン E アセテート ナノディスパージョン (例 12)

表 3						
貯蔵	貯蔵条件	貯蔵条件		pH 直径 4 [nm]	標準偏差 [%]	ビタミン E アセテート含有率 [%] ⁵
期間 [月]	温度 [°C]					
0		6.1	12.2	5.5	2.04	
3	7	6.1	16.1	6.6	2.02	
	25	6.1	17.5	7.0	2.04	
	40	6.0	15.4	6.8	2.01	
6	7	6.1	17.0	6.9	2.04	
	25	6.0	17.6	7.2	2.03	
	40	6.0	20.8	7.9	2.02	

⁽注) 4: 粒子径および粒子径分布は、レーザー光散乱 (Nicomp 370 サブミクロン粒子径計によ る、体積を計量)によって測定した。

[0191]

ナノディスパージョンを用いる化粧品最終処方物の例 例14:O/Wトリートメントローション

2.00% ポリグリセリンメチルグルコースジステアレート 6.50% カプリン酸/カプリル酸トリグリセリド 6.50% 鉱油 3.00% グリセリン 5.00% 例12のナノディスパージョン 0.20% Carbomer 10.00%

フェノキシエタノール+パラヒドロキシ安息香酸エステル($C_1 \sim C_4$)混合物

0.30% 0.30%

水酸化ナトリウム(45%)

0.09%

水

アルコール

合計100.00%になる量

[0192]

例15:UV保護を有する(O/W)デイクリーム

ポリエチレングリコール (5) グリセリンステアレート 5.0% 2.0% Steareth-21 30.0% 鉱油 2.0% セチルアルコール 1.0% 微晶質ロウ 6.0% プロピレングリコール 10.0% 例13のナノディスパージョン

フェノキシエタノール+パラヒドロキシ安息香酸エステル ($C_1 \sim C_4$) 混合物

0.30%

水

合計100.00%になる量

[0193]

例16:脂肪回復性を有する液状合成洗剤

ポリオキシエチレン脂肪アルコールエーテル硫酸塩 7.5% 3.0% 脂肪回復剤 2.0% パールラスタ 1.0% 増粘剤

^{5.} ピタミンEアセテート合有率は、HPLCによって開定した。

	例10のナノディスパージョン			5.0%
	香料			0.3%
	水		合計10	0.00%になる量
[0194]	A	•	да, 2 о	• • • • • • • • • • • • • • • • • • • •
101941	例17:トリートメント性を	ちする海風足		
	ポリオキシエチレンラウリル			9.0%
	ココナッツ脂肪酸ジエタノー		,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,,	2. 0%
	ポリエチレングリコール(3)		テル	3. 0%
	香料		, , , , ,	1.0%
	骨付 例7のナノディスパージョン			4.0%
	防腐剤、クエン酸、塩化ナト	11 27 7 7	소計 1	.00.00%になる量
101051	防阀和、グエン酸、塩化デド	クリム、水	H 11 1	00.00/010452
[0195]	四1000世界〇八百四一〇一	• ,		
	例18:沈静O/Wローション		50%	
	ステアリン酸		00%	
	ソルビタンモノステアレート		00%	
	ソルビタンモノオレエート		00%	
	鉱油			
	パルミチン酸セチル		00%	
	ポリメチルシロキサン		50%	
	グリセリン	_ :	00%	
	1, 2-プロピレングリコー		00%	
	例11のナノディスパージョ		00%	
	ポリアクリル酸		15%	
	水酸化ナトリウム		30%	
	香料		50%	=
<u>-</u>	防腐剤、水	合計100.	00%になる	<u>.</u>
[0196]				
	例19:皮膚保護W/Oロー		0 00/	
	グリセリンソルビタン脂肪酸			
	ポリオキシエチレン脂肪酸エ			
	イソステアリン酸イソプロピ)V	5.0%	
	鉱油		7.0%	
	パルミチン酸イソプロピル		4.0%	
	小麦胚芽油		3.0%	
	プロピレングリコール		3.8%	
	例12のナノディスパージョ	ン	5.0%	
	$MgSO_4 \times 7H_2O$		0.7%	
	香料		0.5%	- H
	防腐剤、水	合語	†100%にな	る量
[0197]				
	例20:メーキャップクリー			
	グリセリンモノステアレート		4.0	
	セチルアルコール		1.0	
	ステアリン酸		2. 0	
	鉱油		4.5	
	セチルステアリルオクタン酸	エステル	5. 0	
	パルミチン酸オクチル		3. 0	
	タルカム		4.0	
	二酸化チタン		1.5	
	酸化鉄		0.8	%

プロピレングリコール 5.0% ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート 1.0% キサンタン 0.4% マグネシウムーアルミニウムーケイ酸塩 0.3% グリセリン 5.0% 6計100%になる量

[0198]

例21:デクスパンテノール用量制御スプレー

フェノキシエタノール

0.5%

例11のナノディスパージョン

合計100%になる量

フロントページの続き

(72)発明者ディートマー ヒューグリン
ドイツ連邦共和国
ンゲン
(72)発明者(72)発明者
アンドレアス
アンドレアス
アンドレアス
ウェルナー
スイス国
イス国
イラー ツェリンプラッツ
イラーセ
イラー
マスイス国
イラーセ
イラーセ
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イラーと
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス
イス